

INTERNATIONAL COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

To:

Assistant Commissioner for Patents
United States Patent and Trademark
Office
Box PCT
Washington, D.C.20231
ÉTATS-UNIS D'AMÉRIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing:

20 January 2000 (20.01.00)

International application No.:

PCT/EP99/04585

Applicant's or agent's file reference:

Le A 33 132-PC HOR

International filing date:

02 July 1999 (02.07.99)

Priority date:

09 July 1998 (09.07.98)

Applicant:

ANDREE, Roland et al

1. The designated Office is hereby notified of its election made:



in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:

30 November 1999 (30.11.99)



in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was



was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer:

J. Zahra

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

THIS PAGE BLANK (USPTO)

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 02 OCT 2000

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT PCT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts Le A 33 132-PC HOR	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsbericht (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/04585	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 02/07/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 09/07/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D239/54		
Anmelder BAYER AG et al.		



- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationale vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

 Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderische Tätigkeit und der gewerbliche Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 30/11/1999	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 29.09.2000
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Mathys, E Tel. Nr. +49 89 2399 8596 

THIS PAGE BLANK (USPTO)

I. Grundlag des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

Beschreibung, Seiten:

1-51 ursprüngliche Fassung

Patentansprüche, Nr.:

1-17 ursprüngliche Fassung

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
☐ Ansprüche, Nr.:
☐ Zeichnungen, Blatt:

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)):

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	5
	Nein: Ansprüche	1-4,6-17
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	
	Nein: Ansprüche	1-17
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-17
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen

siehe B iblatt

THIS PAGE BLANK (USPTO)

VI. Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)
und / oder
2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)
siehe Beiblatt

THIS PAGE BLANK (USPTO)

PUNKT V

Neuheit

(D1) DE-A-195 27 570 offenbart Verbindungen, welche durch vorliegende Ansprüche 1 bis 4 und 6 bis 10 umfasst sind. Die Tatsache, dass D1 keine spezifische Verbindung mit R^3 =substituiertes Phenyl offenbart ist nicht erheblich, da man durch bloße Streichung von Bedeutungen von R^3 dazu gelangt und somit keine Auswahl geltend gemacht werden kann. Da D1 auch die Herstellung der Verbindungen, die Zwischenprodukte sowie deren Verwendung als Herbizide offenbart, sind neben oben genannten auch die Ansprüche 11 bis 17 nicht neu.

Ansprüche 1 bis 4 und 6 bis 17 erfüllen somit die Erfordernisse des Artikels 33(2) PCT nicht.

Erfinderische Tätigkeit

Vorliegender neuer Teil stellt entweder eine Auswahl (im Falle R^1 = Amino) der allgemeinen Offenbarung von D1 dar oder die Verbindungen unterscheiden sich im wesentlichen nur dadurch von in D1 offenbarten, dass die 3-Aminogruppe am 3,6-Dihydro-2,6-dioxo-(2H)-pyrimidin durch Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl ersetzt ist.

Von den aus der (D2) WO-A-93/14073 bekannten Verbindungen gleicher Wirkungsrichtung unterscheiden sie sich im wesentlichen nur dadurch, dass der ortho-Substituent am N-Phenylrest endständig eine substituierte Phenylgruppe aufweist.

Sofern neue Teile eine Auswahl aus D1 darstellen, sind sie im Hinblick auf die Offenbarung von D1 alleine, andernfalls ausgehend von D1 im Hinblick auf die aus D2 (siehe Definition von R^1), bzw. ausgehend von D2 im Hinblick auf die aus D1 (siehe Definition von R^3) bekannten Äquivalenzen, naheliegend.

Ein gegenüber D1 abgegrenzter Gegenstand würde somit die Erfordernissen des Artikels 33(3) PCT nicht erfüllen.

Eine erfinderische Tätigkeit für neue Verbindungen wäre nur dann gegeben, wenn für diese anhand von Vergleichsversuchen gegenüber den strukturell nächstkommenden Verbindungen des genannten Standes der Technik unerwartete Eigenschaften oder Vorteile (bzw. die unerwartete Lösung einer noch nicht gelösten Aufgabe) nachgewiesen würde.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

Patentbegründendes müsste sich dabei auf den ganzen beanspruchten Rahmen erstrecken. Vorliegend verwendete breite Definitionen (wie z.B. substituiert (ohne Angabe der Substituenten), usw.) sind dazu keinesfalls geeignet. Es scheint sogar, dass in Anbetracht des äusserst nahen Standes der Technik bestenfalls spezifische offenbarte Verbindungen beansprucht werden könnten und von diesen ausgehend keine oder eine nur sehr begrenzte Verallgemeinerung möglich wäre.

Die Patentfähigkeit von Verfahren und Zwischenprodukten hinge von der Patentfähigkeit der entsprechenden Endprodukte ab.

PUNKT VI

Diesem Bescheid liegt die Annahme zugrunde, daß alle Ansprüche die Priorität des Anmeldetags des Prioritätsdokuments geniessen. Sollte sich später herausstellen, daß dies nicht zutrifft, so würde auch die (D3) WO 98-A-41093 relevant werden.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference Le A 33 132-PC HOR	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/04585	International filing date (day/month/year) 02 July 1999 (02.07.99)	Priority date (day/month/year) 09 July 1998 (09.07.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 239/54,		
Applicant BAYER AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☒ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 30 November 1999 (30.11.99)	Date of completion of this report 29 September 2000 (29.09.2000)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

THIS PAGE BLANK

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/04585

I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.*):

☒ the international application as originally filed.

☒ the description, pages 1-51, as originally filed,

pages _____, filed with the demand,

pages _____, filed with the letter of _____,

pages _____, filed with the letter of _____.

☒ the claims, Nos. 1-17, as originally filed,

Nos. _____, as amended under Article 19,

Nos. _____, filed with the demand,

Nos. _____, filed with the letter of _____,

Nos. _____, filed with the letter of _____.

☐ the drawings, sheets/fig _____, as originally filed,

sheets/fig _____, filed with the demand,

sheets/fig _____, filed with the letter of _____,

sheets/fig _____, filed with the letter of _____.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages _____

☐ the claims, Nos. _____

☐ the drawings, sheets/fig _____

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

THIS PAGE BLANK (USPTO)

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	5	YES
	Claims	1-4, 6-17	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-17	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanationsNovelty

(D1) DE-A-195 27 570 discloses compounds which are comprised in the present Claims 1 to 4 and 6 to 10. The fact that D1 does not disclose a specific compound in which R³ is substituted phenyl is unimportant, since that could be achieved simply by deleting some of the meanings of R³, and thus the applicant cannot assert that a selection is involved. Since D1 also discloses the preparation of the compounds, the intermediate products and their use as herbicides, the aforementioned claims and Claims 11 to 17 are not novel. Consequently, Claims 1 to 4 and 6 to 17 do not meet the requirements of PCT Article 33(2).

Inventive step

The claimed compounds either contain novel components which represent a selection (if R¹ = amino) from the general disclosure of D1, or differ essentially from those disclosed in D1 only in that the 3-amino group on the 3,6-dihydro-2,6-dioxo-(2H)-pyrimidine is replaced by hydrogen or optionally substituted alkyl.

The claimed compounds differ from the compounds known from (D2) WO-A-93/14073, which produce a similar effect, essentially only in that the ortho substituent on the N-

THIS PAGE BLANK (USPTO)

phenyl group has a terminal substituted phenyl group.

The novel components which represent a selection from D1 are obvious either in the light of D1 alone, or, taking D1 as a basis, in the light of the equivalents known from D2 (see the definition of R^1), or, taking D2 as a basis, in the light of the equivalents known from D1 (see the definition of R^3).

Consequently, subject matter delimited over D1 would not meet the requirements of PCT Article 33(3).

An inventive step could only be acknowledged for novel compounds if, on the basis of comparative tests, they were to show unexpected properties or advantages (or the unexpected solution to an as yet unsolved problem) when compared with the compounds of the cited prior art which are the closest in terms of structure.

Substantiation for patentability must cover the entire scope of the claims. The broad definitions which are currently used (such as, for example, substituted (without any indication of the substituents), etc.) are not suitable for this purpose. It even seems, in view of the very close prior art, that at best it might be possible to claim specifically disclosed compounds, but that generalising from these would not be possible or would only be possible to a very limited extent.

The patentability of processes and intermediate products depends on the patentability of the corresponding end products.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

ational application No.
PCT/EP 99/04585

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: Box VI

This report is based on the assumption that all the claims enjoy the priority of the filing date of the priority document. Should this later prove not to be the case, then (D3) WO-A-98/41093 will also be of relevance.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁷ : C07D 239/54, A01N 43/54, C07C 255/59, 327/48, 217/90, 265/12, 271/28	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/02866 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Januar 2000 (20.01.00)
--	----	--

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/04585

(22) Internationales Anmeldedatum: 2. Juli 1999 (02.07.99)

(30) Prioritätsdaten:

198 30 693.8 9. Juli 1998 (09.07.98) DE
198 53 864.2 23. November 1998 (23.11.98) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ANDREE, Roland [DE/DE];
Dechant-Miebach-Weg 37, D-40764 Langenfeld (DE).
DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestrasse 38,
D-40764 Langenfeld (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE];
Ackerweg 9, D-40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf
[DE/DE]; Am Kloster 69, D-42799 Leichlingen (DE).
WETCHOLOWSKY, Ingo [DE/BR]; Condomínio Estância
Marambaia, Rua Avaré, 500, CEP-13280-000 Vinhedo, SP
(BR). SCHWARZ, Hans-Georg [DE/DE]; Settiner Strasse
7 a, D-40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-
SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE,
SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN,
YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD,
SL, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG,
KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH,
CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

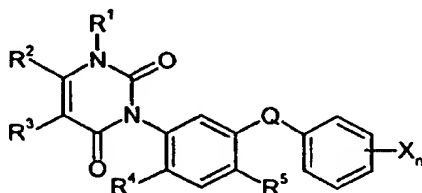
Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Handwritten signature

(54) Title: SUBSTITUTED PHENYL URACILS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PHENYLURACILE



(I)

(57) Abstract

The invention relates to novel substituted phenyl uracils of general formula (I) wherein n, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and X have the meanings given in the description, to methods and novel intermediate products for producing said substituted phenyl uracils and to their use as herbicides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile der allgemeinen formel (I), in welcher n, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Herbizide.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

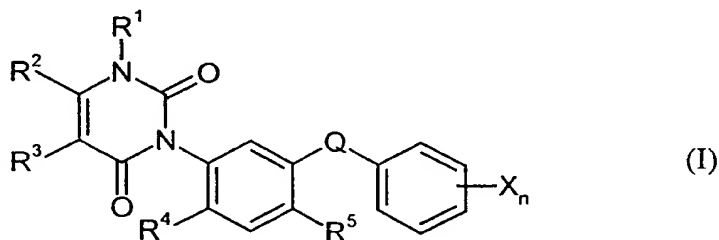
AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidshan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

Substituierte Phenyluracile

Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Herbizide.

Bestimmte substituierte Aryluracile sind bereits aus der (Patent-)Literatur bekannt (vgl. EP-A-255047, EP-A-260621, EP-A-408382, EP-A-438209, EP-A-473551, EP-A-517181, EP-A-563384, WO-A-91/00278, WO-A-91/07393, WO-A-93/14073, WO-A-98/41093, US-A-4979982, US-A-5084084, US-A-5127935, US-A-5154755, US-A-5169430, US-A-5486610, US-A-5356863). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt.

Es wurden nun neue substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)



in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 steht,

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(Alkyl) steht,

R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,

5 R⁵ für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxy steht, und

10 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy, Alkylaminocarbonyloxy, Dialkylaminocarbonyloxy, Phenylcarbonyloxy, Alkylcarbonylamino, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxy-carbonyl, Alkynyl, Alkynyloxy oder Alkynyloxycarbonyl steht - wobei für den
15 Fall, daß n größer als 1 ist, X in den einzelnen möglichen Verbindungen auch verschiedene der angegebenen Bedeutungen haben kann,

gefunden.

20

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

25

Soweit die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) Substituenten mit asymmetrischen Kohlenstoffatomen enthalten, betrifft die Erfindung jeweils die R-Enantiomeren und die S-Enantiomeren sowie beliebige Mischungen dieser Enantiomeren, insbesondere die Racemate.

n steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4;

30

- Q steht bevorzugt für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(C₁-C₄-Alkyl);
- 5 R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl;
- 10 R² steht bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;
- R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl;
- 15 R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder Brom;
- 20 R⁵ steht bevorzugt für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- 25 X steht bevorzugt für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyl-oxycarbonyl, C₂-C₄-Alkinyl-oxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylamino-carbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-carbonyl, Phenoxy-carbonyl, Benzyloxy-carbonyl, Phenylamino-carbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den
- 30

- Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy oder Alkylaminocarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für
- 5 Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminocarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für Phenylcarbonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkylcarbonyl-
- 10 amino, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy-
- carbonyl substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen;
- n steht besonders bevorzugt für die Zahlen 1, 2 oder 3;
- 15 Q steht besonders bevorzugt für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(CH₃);
- R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenen-
- 20 falls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl;
- R² steht besonders bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl
- 25 oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl;
- R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils
- 30 gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl;
- R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor oder Chlor;

- R⁵ steht besonders bevorzugt für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl;
- 5 X steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxy-carbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituier-
15 tes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, für Dimethylamino oder Diethylamino, für jeweils
20 gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Butyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Propoxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy, n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, für Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyloxy oder Diethylaminocarbonyloxy, für Phenylcarbonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Acetylamino, Propionylamino, n- oder i-Butyrylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propyl-
- 25
- 30

sulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl, Propenyl, Propenyloxy, Propenyloxy-carbonyl, Ethinyl, Propinyl, Propinyloxy oder Propinyloxycarbonyl.

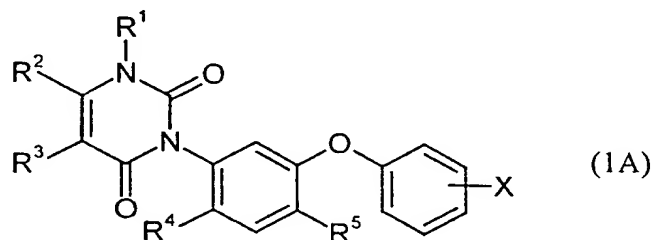
5

Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

10

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (IA),



15

in welcher

R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

20

R² für Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Difluormethyl oder Pentafluorethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

25

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano oder Thiocarbamoyl steht, und

- 5 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thio-
carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano,
Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy,
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxy-
carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-
oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-
yl-oxy-carbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-
Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl,
10 Phenoxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzyl-
aminocarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio,
Ethylthio, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxy-
carbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.
- 15 Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der
Formel (IA), bei welchen
- R¹ für Methyl steht,
- 20 R² für Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Difluormethyl oder Pentafluorethyl
steht,
- R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,
- 25 R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
- R⁵ für Fluor, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht, und
- 30 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thio-
carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano,
Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy,

Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxy-carbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (IA), bei welchen

R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thicarbamoyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht, und

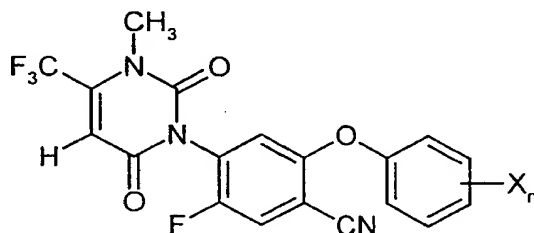
X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-

Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe 1

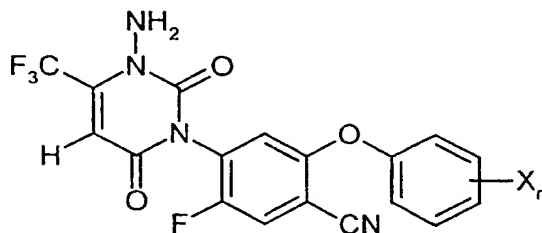


X_n hat dabei die in der nachstehenden Auflistung angegebenen Bedeutungen:

2-Hydroxy, 3-Hydroxy, 4-Hydroxy, 2-Cyano, 3-Cyano, 4-Cyano, 2-Carboxy, 3-Carboxy, 4-Carboxy, 2-Fluor, 3-Fluor, 4-Fluor, 2,3-Difluor, 2,4-Difluor, 2,5-Difluor, 2,6-Difluor, 3,4-Difluor, 3,5-Difluor, 2-Chlor, 3-Chlor, 4-Chlor, 2,3-Dichlor, 2,4-Dichlor, 2,5-Dichlor, 2,6-Dichlor, 3,4-Dichlor, 3,5-Dichlor, 2-Brom, 3-Brom, 4-Brom, 2-Methyl, 3-Methyl, 4-Methyl, 2,3-Dimethyl, 2,4-Dimethyl, 2,5-Dimethyl, 2,6-Dimethyl, 3,4-Dimethyl, 3,5-Dimethyl, 2-Trifluormethyl, 3-Trifluormethyl, 4-Trifluormethyl, 2-Methoxy, 3-Methoxy, 4-Methoxy, 2,4-Dimethoxy, 2,5-Dimethoxy, 2,6-Dimethoxy, 3,4-Dimethoxy, 2-Difluormethoxy, 4-Difluormethoxy, 2-Trifluormethoxy, 4-Trifluormethoxy, 4-Ethoxy, 4-Methylthio, 4-Ethylthio, 4-Methoxy-

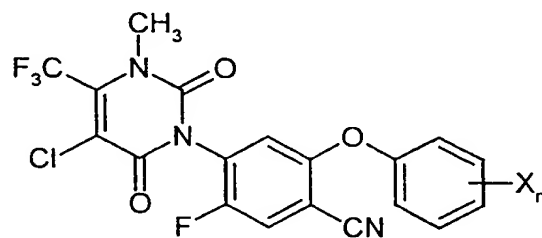
carbonyl, 4-Ethoxycarbonyl, 4-Carboxymethoxy, 4-Methoxycarbonylmethoxy, 4-Ethoxycarbonylmethoxy, 4-n-Propoxycarbonylmethoxy, 4-i-Propoxycarbonylmethoxy, 4-(1-Carboxy-ethoxy), 4-(1-(Methoxycarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(Ethoxycarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(n-Propoxycarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(i-Propoxycarbonyl)-ethoxy), 4-(Allyloxycarbonylmethoxy), 4-(1-(Allyloxycarbonyl)-ethoxy), 4-(Propargyloxycarbonylmethoxy), 4-(1-(Propargyloxycarbonyl)-ethoxy), 4-(Benzyl-oxycarbonylmethoxy), 4-(1-(Benzyloxycarbonyl)-ethoxy), 4-(Aminocarbonylmethoxy), 4-(Methylaminocarbonylmethoxy), 4-(Ethylaminocarbonylmethoxy), 4-(n-Propylaminocarbonylmethoxy), 4-(i-Propyl-aminocarbonylmethoxy), 4-(Dimethylaminocarbonylmethoxy), 4-(1-(Methylaminocarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(Ethylaminocarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(n-Propylaminocarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(i-Propylaminocarbonyl)-ethoxy), 4-(1-(Dimethylaminocarbonyl)-ethoxy), 4-(2-Methoxycarbonyl-ethenyl), 4-(2-Ethoxycarbonyl-ethenyl).

15 Gruppe 2



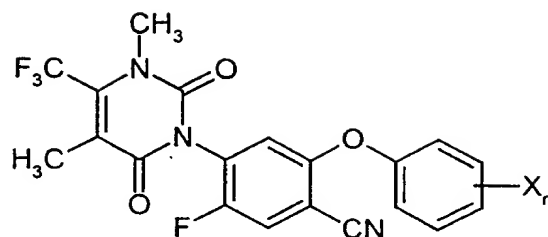
X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 3



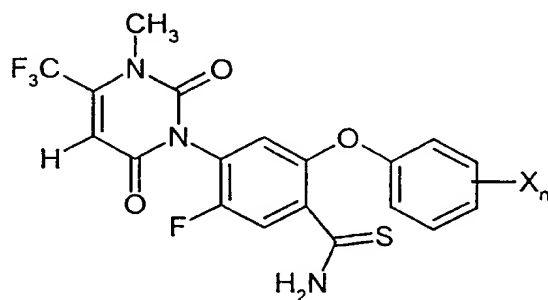
20

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

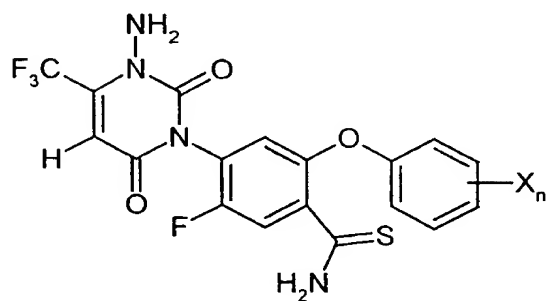
Gruppe 4

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

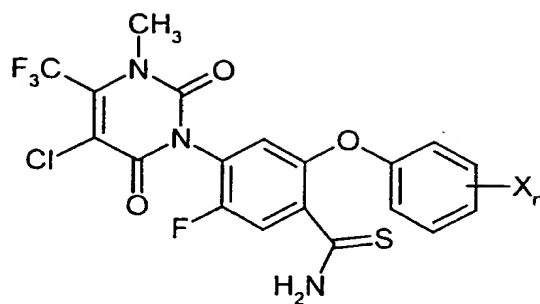
Gruppe 5

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 6

10

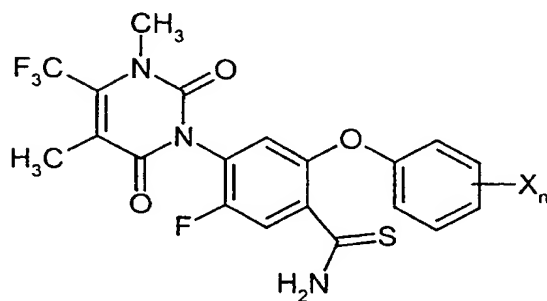
X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 7

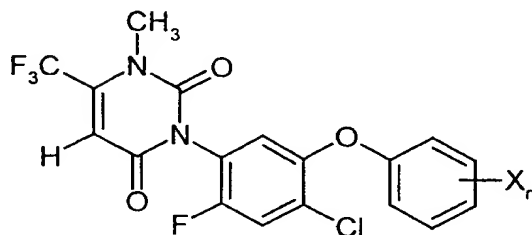
X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

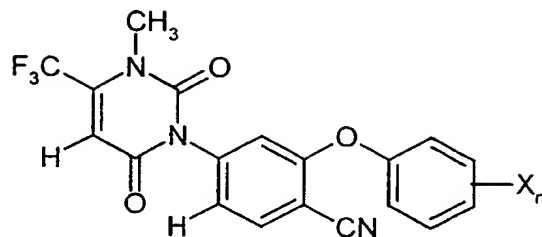
Gruppe 8



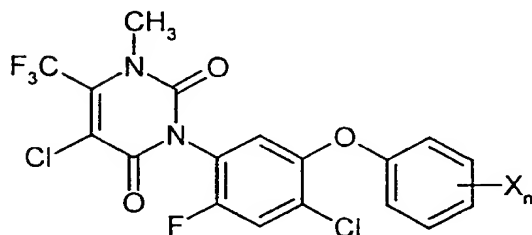
X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9

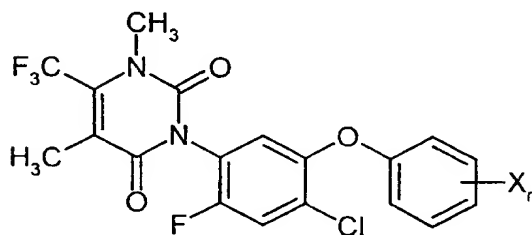
X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 10

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

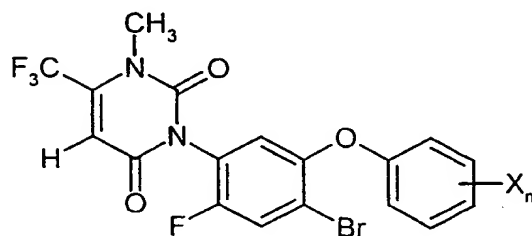
5 Gruppe 11

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 12

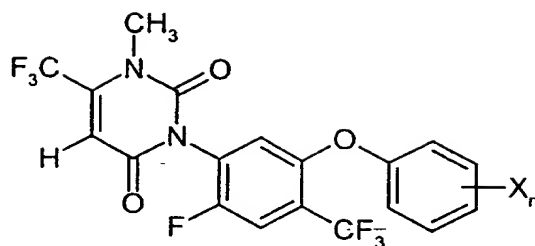
10

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 13

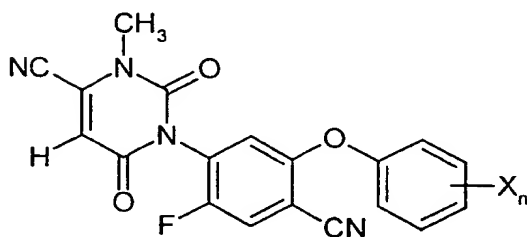
15

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 14

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

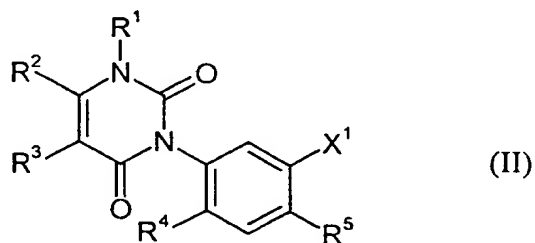
Gruppe 15

X_n hat dabei die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

- 10 Die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I) weisen interessante biologische Eigenschaften auf. Sie zeichnen sich insbesondere durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

15 Man erhält die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I), wenn man

(a) Halogenophenyluracile der allgemeinen Formel (II)



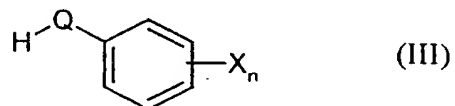
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die oben angegebene Bedeutung haben und

X^1 für Halogen steht,

5

mit Arylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

10

n , Q und X die oben angegebene Bedeutung haben,

- oder mit Metallsalzen von Verbindungen der allgemeinen Formel (III) -

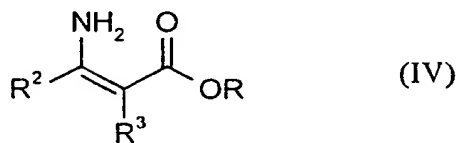
gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in

15

Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

(b) Aminoalkensäureester der allgemeinen Formel (IV)



20

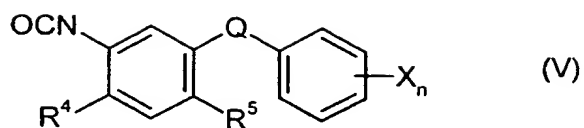
in welcher

R^2 und R^3 die oben angegebene Bedeutung haben und

25

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

mit Arylisocyanaten der allgemeinen Formel (V)

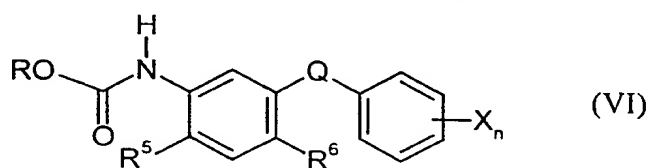


in welcher

n, Q, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

5

oder mit Arylurethanen (Arylcarbamaten) der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

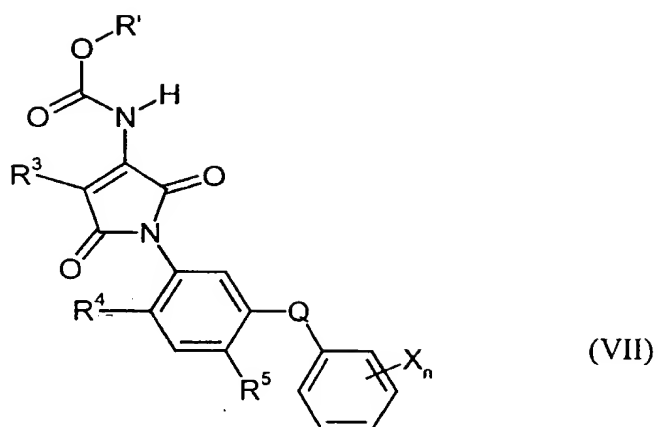
10 n, Q, R⁵, R⁶ und X die oben angegebene Bedeutung haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in
15 Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

(c) N-Aryl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen Formel (VII)



in welcher

n, Q, R³, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben und

5

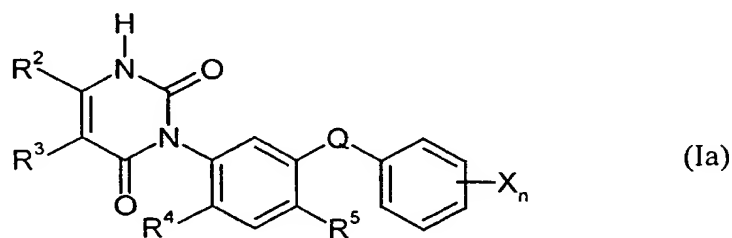
R' für Alkyl steht,

mit einem Metallhydroxid in Gegenwart von Wasser und gegebenenfalls in Gegenwart eines organischen Lösungsmittels umgesetzt,

10

oder wenn man

(d) substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (Ia)



15

in welcher

n, Q, R², R³, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

mit 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol oder mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (VIII)



5

in welcher

A^1 für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und

10

X^2 für Halogen oder die Gruppierung $-\text{O}-\text{SO}_2-\text{O}-\text{A}^1$ steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

15

und gegebenenfalls im Anschluß daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

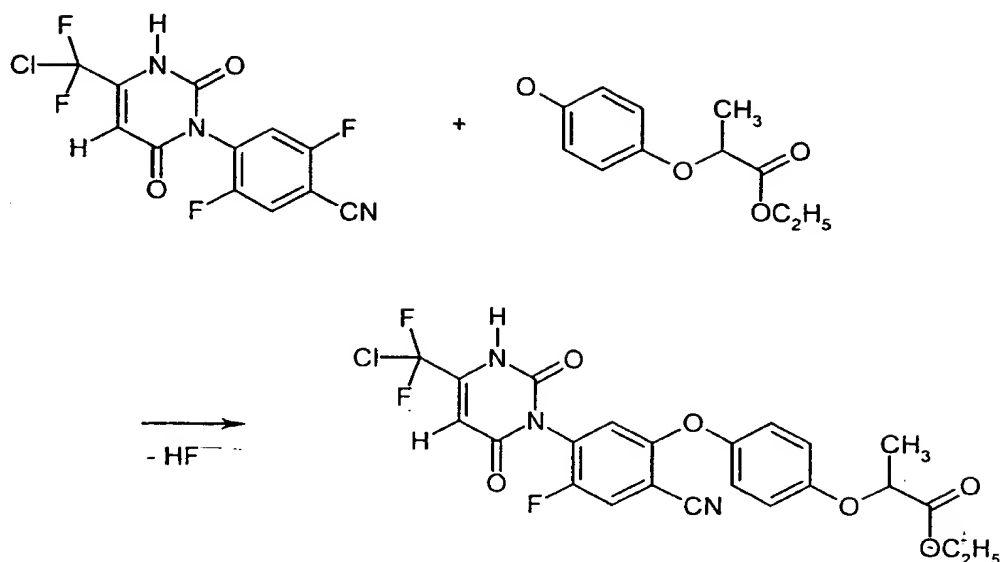
20

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise durch Veresterung bzw. Hydrolyse (z.B. $\text{X}: \text{OCH}_2\text{COOH} \rightarrow \text{OCH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$, $\text{OCH}(\text{CH}_3)\text{COOCH}_3 \rightarrow \text{OCH}(\text{CH}_3)\text{COOH}$), Umsetzung mit Dicyan bzw. Hydrosulfid (z.B. $\text{R}^5: \text{Br} \rightarrow \text{CN}$, $\text{CN} \rightarrow \text{CSNH}_2$, Umwandlung von Carboxyverbindungen in andere Carbonsäurederivate nach üblichen Methoden (z.B. $\text{R}^2: \text{COOH} \rightarrow \text{CN}$, $\text{CN} \rightarrow \text{CSNH}_2$, $\text{COOH} \rightarrow \text{COOCH}_3$, $\text{COOCH}_3 \rightarrow \text{CONH}_2$); vgl. die Herstellungsbeispiele).

25

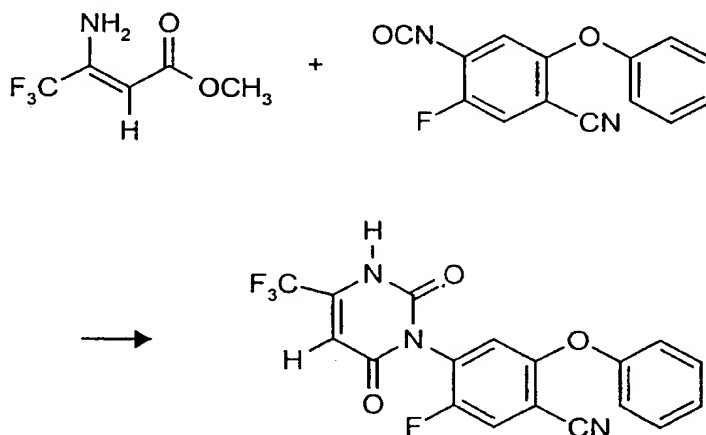
30

Verwendet man beispielsweise 1-(4-Cyano-2,5-difluor-phenyl)-4-chlordifluor-methyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und 1-(4-Hydroxy-phenoxy)-propionsäure-ethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



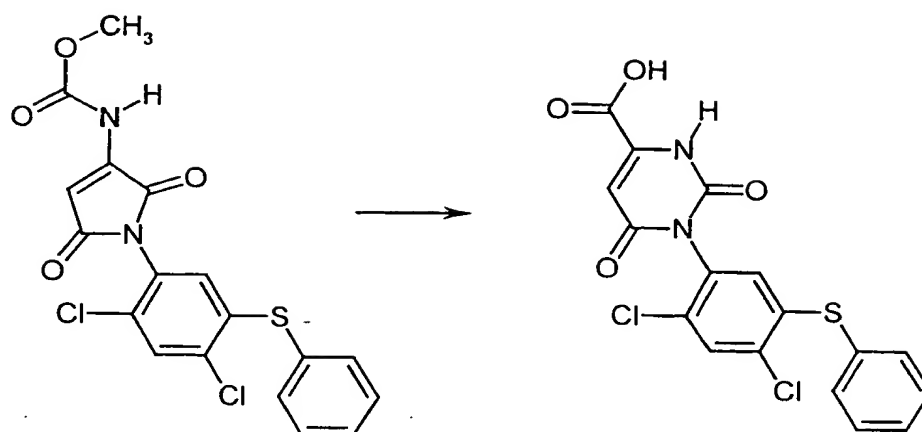
Verwendet man beispielsweise 3-Amino-4,4,4-trifluor-crotonsäuremethylester und 4-Cyano-2-fluor-5-phenoxy-phenylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

5

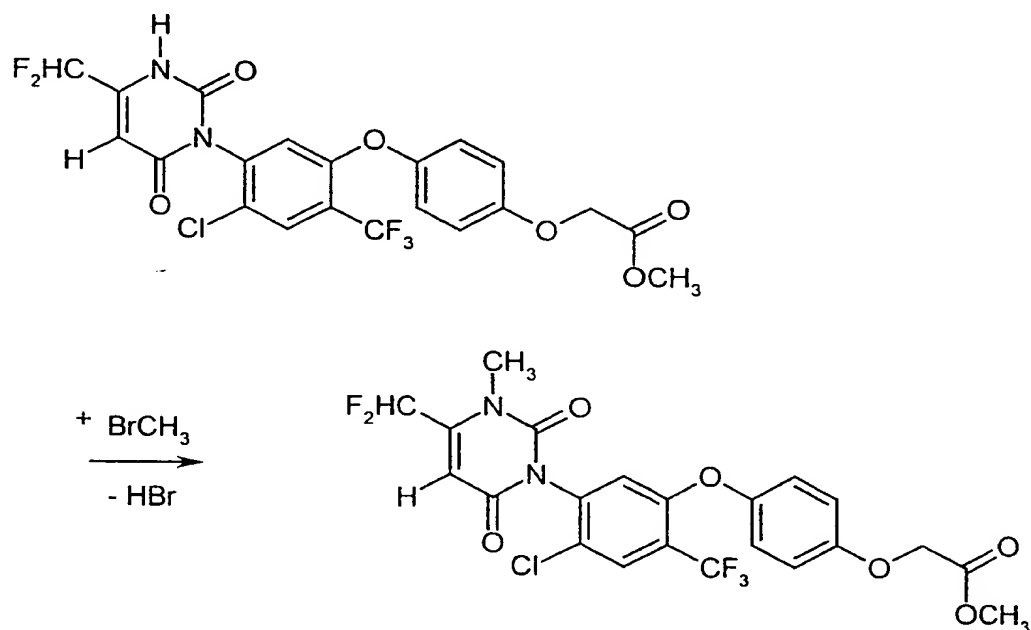


Verwendet man beispielsweise [1-(2,4-Dichlor-5-phenylthio-phenyl)-2,5-dioxo-2,5-dihydro-1H-pyrrrol-3-yl]-carbamidsäure-methylester als Ausgangsstoff, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

10



Verwendet man beispielsweise 1-[2-Chlor-4-trifluormethyl-5-(4-methoxycarbonyl-methoxy-phenoxy)-phenyl]-4-difluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und Methylbromid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Halogenophenyluracile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 an-

gegeben wurden; X^1 steht vorzugsweise für Fluor oder Chlor, insbesondere für Fluor.

5 Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A-648749).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Arylverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben n, Q und X insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits
10 oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, Q und X angegeben wurden.

15 Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminoalkensäureester sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (IV)
20 haben R^2 und R^3 insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für R^2 und R^3 angegeben worden sind; R steht vorzugsweise für C_1 - C_4 -Alkyl, Phenyl oder Benzyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

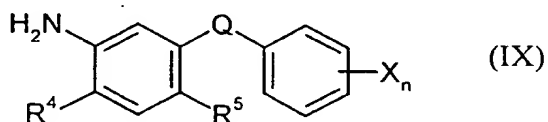
25 Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Heterocycl. Chem. 9 (1972), 513-522).

30 Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Arylisocyanate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der all-

gemeinen Formel (V) haben n, Q, R⁴, R⁵ und X insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, Q, R⁴, R⁵ und X angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen Arylisocyanate der allgemeinen Formel (V), wenn man Anilinderivate der allgemeinen Formel (IX)



in welcher

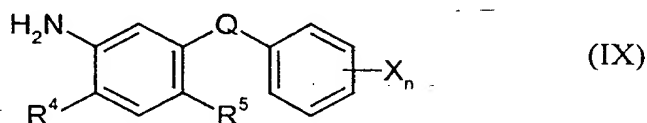
n, Q, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Phosgen in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Chlorbenzol, bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C umgesetzt (vgl. z.B. auch EP-A-648749).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) gegebenenfalls als Ausgangsstoffe zu verwendenden Arylurethane sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (VI) haben n, Q, R⁴, R⁵ und X insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, Q, R⁴, R⁵ und X angegeben worden sind; R steht vorzugsweise für C₁-C₄-Alkyl, Phenyl oder Benzyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VI) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen Arylurethane der allgemeinen Formel (VI), wenn man Anilinderivate der allgemeinen Formel (IX)



in welcher

n, Q, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorcarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (X)



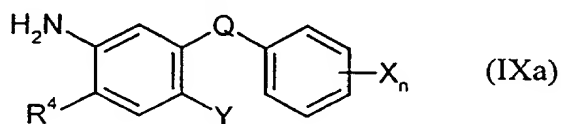
in welcher

R die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Pyridin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Methylenchlorid, bei Temperaturen zwischen -20°C und +100°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die als Vorprodukte benötigten Anilinderivate der allgemeinen Formel (IX) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Justus Liebigs Ann. Chem. 740 (1970), 169-179; US-A-3715395; US-A-3914418; DE-A-2748554; DE3736089).

Noch nicht bekannt und als neue Stoffe Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind die Anilinderivate der allgemeinen Formel (IXa)



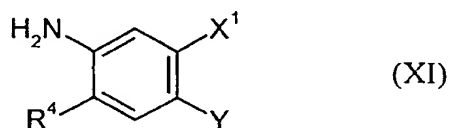
in welcher

5

n, R⁴ und X die oben angegebene Bedeutung haben und

Y für Cyano, Thiocarbamoyl oder Trifluormethyl steht.

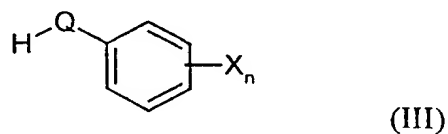
10 Man erhält die neuen Anilinderivate der allgemeinen Formel (IXa), wenn man Aniline der allgemeinen Formel (XI)



in welcher

15 R⁴, X¹ und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Arylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

20

n, Q und X die oben angegebene Bedeutung haben,

- oder mit Metallsalzen von Verbindungen der allgemeinen Formel (III) -

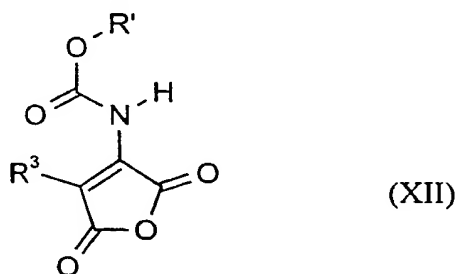
gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Natriumhydrid, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. N-Methylpyrrolidon, bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

5

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden N-Aryl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (VII) haben n, Q, R³, R⁴, R⁵ und X insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, Q, R³, R⁴, R⁵ und X angegeben worden sind; R⁴ steht vorzugsweise für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

15

Man erhält die neuen N-Aryl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen Formel (VII), wenn man (2,5-Dioxo-2,5-dihydro-furan-3-yl)-carbamidsäure-alkylester der allgemeinen Formel (XII)



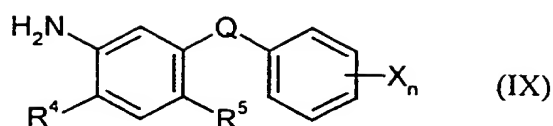
20 in welcher

R³ die oben angegebene Bedeutung hat und

R⁴ für Alkyl (insbesondere für Methyl oder Ethyl) steht,

25

mit Anilinderivaten der allgemeinen Formel (IX)



in welcher

n, Q, R⁴, R⁵ und X die oben angegebene Bedeutung haben,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Essigsäure, bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C umgesetzt.

10

Die Vorprodukte der allgemeinen Formel (XII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE 19604229).

15

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Phenyluracile sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In der Formel (Ia) haben n, Q, R², R³, R⁴, R⁵ und X insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für n, Q, R², R³, R⁴, R⁵ und X angegeben wurden.

20

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) für Verfahren (b) sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung; sie können nach den erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) hergestellt werden.

25

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkylierungsmittel sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In der Formel (VIII) stehen vorzugsweise A¹ für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und X² für Chlor, Brom, Iod, Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy; insbesondere stehen

A¹ für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl und X² für Chlor, Brom, Iod, Methylsulfonyloxy oder Ethylsulfonyloxy.

- 5 Die Ausgangsstoffe der Formel (VIII) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen neben Wasser vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methylisobutylketon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

25

Als Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calciumacetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumamid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-

30

carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie
5 beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-di-isopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin,
10 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Als weitere Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren kommen auch Phasentransfer-Katalysatoren in Betracht. Als Beispiele für solche Katalysatoren
15 seien genannt:

Tetrabutylammonium-bromid, Tetrabutylammonium-chlorid, Tetraoctylammonium-chlorid, Tetrabutylammonium-hydrogensulfat, Methyl-trioctylammonium-chlorid, Hexadecyl-trimethylammonium-chlorid, Hexadecyl-trimethylammonium-bromid,
20 Benzyl-trimethylammonium-chlorid, Benzyl-triethylammonium-chlorid, Benzyl-trimethylammonium-hydroxid, Benzyl-triethylammonium-hydroxid, Benzyl-tributylammonium-chlorid, Benzyl-tributylammonium-bromid, Tetrabutylphosphonium-bromid, Tetrabutylphosphonium-chlorid, Tributyl-hexadecylphosphonium-bromid, Butyl-triphenylphosphonium-chlorid, Ethyl-trioctylphosphonium-bromid, Tetra-
25 phenylphosphonium-bromid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise
30 zwischen 10°C und 120°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

5

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

25

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

5 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

10

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

15

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

20

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

25

30

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum-erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulga-

toren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykoether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

25

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-

30

don(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, 5 Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epopropan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-ethyl), Flamprop(-isopropyl), 10 Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-methyl), Flazasulfuron, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-methyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), 15 Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron, Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, 20 Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orben carb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclonefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, 25 Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyrithiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, 30 Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl),

Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

5

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

10

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

15

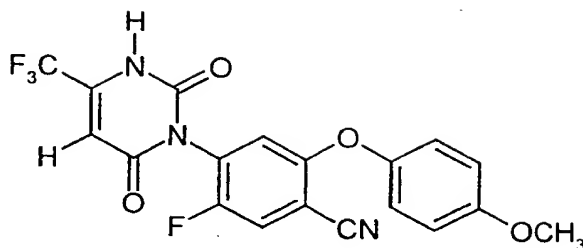
Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

20

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

25

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

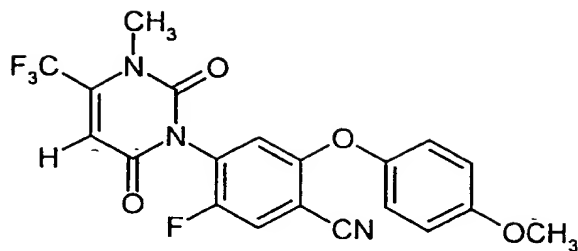
Herstellungsbeispiele:**Beispiel 1**

5 (Verfahren (a))

2,5 g (10 mMol) 4-Methoxy-phenol werden in 50 ml Dimethylsulfoxid vorgelegt und mit 1,6 g Natriumhydrid (60%ig) versetzt. Die Mischung wird 30 Minuten bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Dann werden 3,2 g (10 mMol) 4-(3,6-Dihydro-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-1(2H)-pyrimidin-1-yl)-2,5-difluor-benzonitril dazu gegeben. Die Reaktionsmischung wird 18 Stunden bei 60°C gerührt und anschließend auf etwa die gleiche Volumenmenge 1N-Salzsäure gegossen. Das kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert, mit einer Mischung aus 30 ml Essigsäureethylester und 300 ml Diethylether verrührt und trocken gesaugt. Die organische Mutterlauge wird im Wasserstrahlvakuum eingengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel, Chloroform/Essigsäureethylester, Vol.: 2:1) aufgearbeitet. Die hierbei erhaltene erste Fraktion wird im Wasserstrahlvakuum eingengt, der Rückstand in siedendem Methylenchlorid gelöst, nach Erkalten das überstehende Lösungsmittel abdekantiert, der Rückstand mit Diethylether/Diisopropylether verrührt und das kristalline Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 0,90 g (21% der Theorie) 4-(3,6-Dihydro-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-1(2H)-pyrimidin-1-yl)-5-fluor-2-(4-methoxy-phenoxy)-benzonitril vom Schmelzpunkt 84°C.

25

Beispiel 2

(Verfahren (b))

- 5 Eine Mischung aus 0,50 g (1,2 mMol) 4-(3,6-Dihydro-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-1(2H)-pyrimidin-1-yl)-5-fluor-2-(4-methoxy-phenoxy)-benzonitril, 0,20 g (1,8 mMol) Dimethylsulfat, 0,30 g (2,4 mMol) Kaliumcarbonat und 100 ml Aceton wird 15 Stunden unter Rückfluß erhitzt und anschließend im Wasserstrahlvakuum eingeeengt. Der Rückstand wird mit 50 ml 1N-Salzsäure / 50 ml Essigsäureethylester
- 10 geschüttelt, die organische Phase abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, in Essigsäureethylester gelöst, mit 5%iger wässriger Dinatriumhydrogenphosphat-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand mit Petrolether verrührt und das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.
- 15

Man erhält 0,3 g (57% der Theorie) 4-(3,6-Dihydro-2,6-dioxo-3-methyl-4-trifluormethyl-1(2H)-pyrimidin-1-yl)-5-fluor-2-(4-methoxy-phenoxy)-benzonitril vom Schmelzpunkt 62°C.

20

Analog zu den Herstellungsbeispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

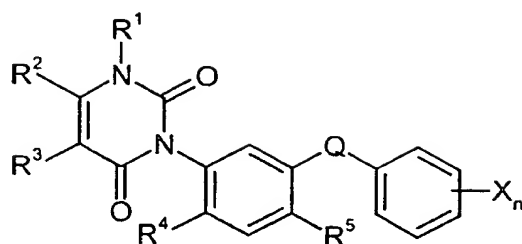
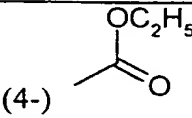

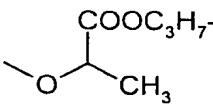

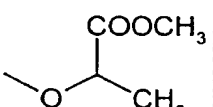
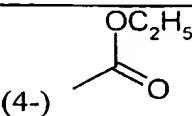
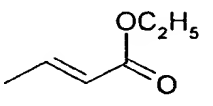
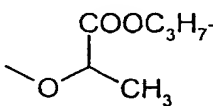
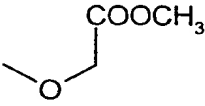
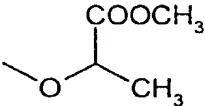
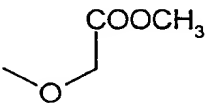
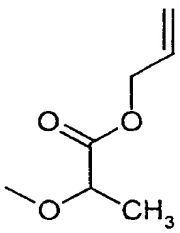
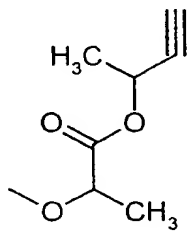
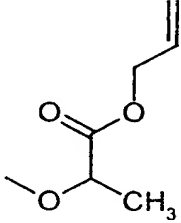
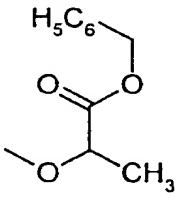
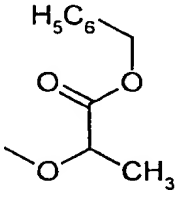


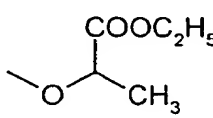
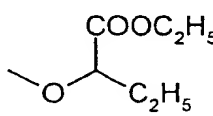
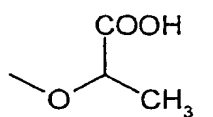
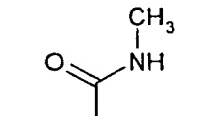
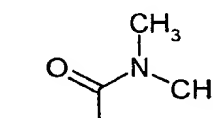
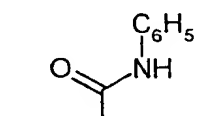
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

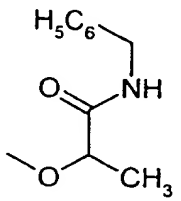

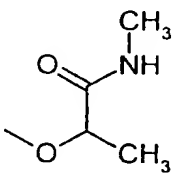

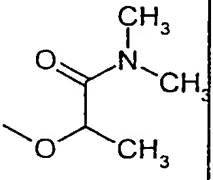
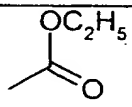
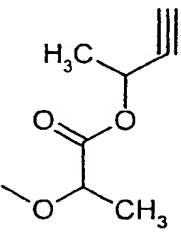
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
3	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
4	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 118°C (R- Enantiomer)
5	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 105°C (R- Enantiomer)
6	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 146°C (R- Enantiomer)
7	1	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 152°C (R- Enantiomer)


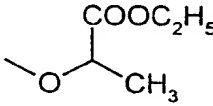






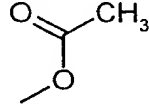
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
8	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	¹ H-NMR: δ=6,42 ppm (s, D ₆ -DMSO)
9	1	O	H	CF ₃	H	F		(4-) OCH ₃	¹ H-NMR: δ=5,63 ppm (s, D ₆ -DMSO)
10	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 95°C (R- Enantiomer)
11	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) 	¹ H-NMR: δ=6,51 ppm (s, D ₆ -DMSO) (R- Enantiomer)
12	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 155°C
13	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 98°C (E-Isomer)
14	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 144°C (R- Enantiomer)
15	0	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	-	

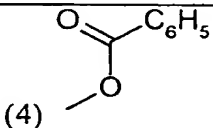
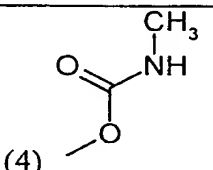
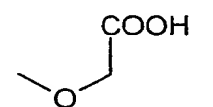
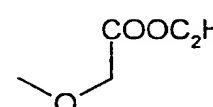
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
16	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) F	
17	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	
18	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) 	
19	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) 	
20	2	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2,4-) Cl ₂	
21	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 173°C (R- Enantiomer)
22	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 148°C (R- Enantiomer)






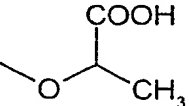
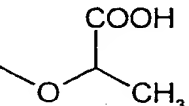
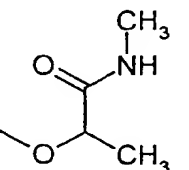
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
23	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) OH	Fp.: 191°C
24	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 126°C (R- Enantiomer)
25	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) OH	¹ H-NMR (D6- DMSO, δ): 6,54 ppm
26	1	O	H	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 64°C (R- Enantiomer)
27	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 75°C (R- Enantiomer)



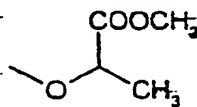
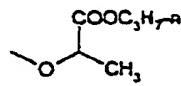
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
28	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 3,5 ppm (Racemat)
29	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	Fp.: 140°C (Racemat)
30	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
31	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
32	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
33	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)

Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
34	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
35	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) 	(R- Enantiomer)
36	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) 	(R- Enantiomer)
37	0	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	-	
38	1	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	
39	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)

Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
40	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) 	(R- Enantiomer)
41	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) OCH ₃	
42	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(2-) OCH ₃	
43	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) OCH ₃	Fp.: 140°C
44	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(3-) OCH ₃	
45	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) OH	
46	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(2-) OH	
47	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) OH	
48	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(3-) OH	
49	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) OH	
50	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) SCH ₃	
51	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F		(4-) SCH ₃	
52	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) SH	
53	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4) 	Fp.: 83°C

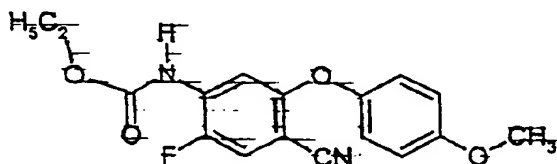
Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
54	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	 (4-)	
55	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	 (4-)	Fp.: 147°C
56	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	 (4-)	
57	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	 (4-)	Fp.: 156°C
58	1	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) OH	
59	1	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) OH	
60	1	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) OH	
61	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) NO ₂	
62	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) NO ₂	
63	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) NO ₂	
64	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(2-) NH ₂	
65	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3-) NH ₂	
66	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) NH ₂	
67	2	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(3,5-) Cl ₂	
68	1	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) Cl	
69	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) CH ₃	

Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
70	1	S	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-) CH ₃	
71	1	O	H		H	F	CN	(4-) OCH ₃	
72	1	O	CH ₃		H	F	CN	(4-) OCH ₃	
73	1	O	CH ₃		H	F	CN	(4-) OCH ₃	log P = 1,92 ^{a)}
74	1	O	CH ₃	CN	H	F	CN	(4-) OCH ₃	\bar{T}_p : 174 °C log P = 2,69 ^{a)}
75	1	O	CH ₃		H	F		(4-) OCH ₃	
76	1	O	CH ₃	CN	H	F	CN	(4-) OH	
77	1	O	CH ₃	CN	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
78	1	O	CH ₃	CN	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)
79	1	O	CH ₃	CN	H	F	CN	(4-) 	(R- Enantiomer)

Bsp.- Nr.	n	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(Position-) X	Physikal. Daten und stereochem. Angaben
80	1	O	CH ₃		H	F		(4-)	 (R- Enantiomer)
81	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-)	(amorph)
82	1	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	(4-)	 (Racemat)

Ausgangsstoffe der Formel (VI):Beispiel (VI-1)

5



2,8 g (11 mMol) 1-Amino-4-cyano-2-fluor-5-(4-methoxy-phenoxy)-benzol werden in 100 ml Methylenchlorid mit 1,7 g Pyridin vorgelegt und bei Raumtemperatur (ca. 20°C) mit 1,25 g (12 mMol) Chlorameisensäure-ethylester versetzt. Die Mischung wird 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit 1N Salzsäure geschüttelt. Die organische Phase wird im Wasserstrahlvakuum eingedunstet, der Rück-

10

stand mit Diethylether/Diisopropylether zur Kristallisation gebracht und das feste Produkt durch Absaugen isoliert.

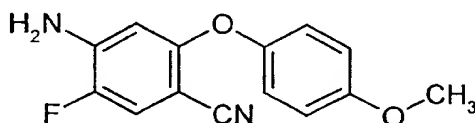
5 Man erhält 1,2 g (34% der Theorie) N-(4-Cyano-2-fluor-5-(4-methoxy-phenoxy)-phenyl)-O-ethyl-carbamat.

$^1\text{H-NMR}$ (D6-DMSO, δ): 7,85 u. 7,89 ppm.

Ausgangsstoffe der Formel (IX):

10

Beispiel (IX-1)



15 1,3 g (10 mMol) 4-Methoxy-phenol in 100 ml N-Methyl-pyrrolidon werden bei Raumtemperatur mit 0,50 g Natriumhydrid (60%ig) und nach kurzem Rühren mit 1,5 g 4-Cyano-2,5-difluor-anilin versetzt. Die Reaktionsmischung wird dann 20 Stunden bei 100°C gerührt. Nach Abkühlen wird mit Wasser und dann mit 1N-Salzsäure verdünnt und nach zweistündigem Rühren wird das feste Produkt durch
20 Absaugen isoliert und auf Ton getrocknet.

Man erhält 1,9 g (73% der Theorie) 1-Amino-4-cyano-2-fluor-5-(4-methoxy-phenoxy)-benzol vom Schmelzpunkt 135°C.

25 Analog zu Beispiel (IX-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (IX) hergestellt werden.

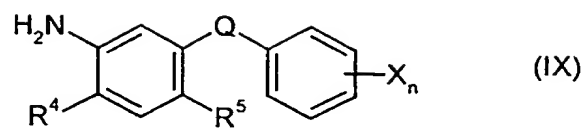
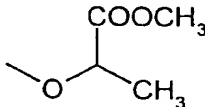


Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (IX)

Bsp.- Nr.	Q	R ⁴	R ⁵	X _n	Physikal. Daten
IX-2	O	F	CN	(3-) OCH ₃	Fp.: 94°C
IX-3	O	F	CN	(2-) OCH ₃	
IX-4	O	F	CN	(4-) Cl	
IX-5	O	F	CN	(3-) Cl	
IX-6	O	F	CN	(2-) Cl	
IX-7	O	F	CN	(4-) OH	
IX-8	O	F	CN	(4-) 	
IX-9	O	F	CN	-	
IX-10	O	F	CN	(4-) F	
IX-11	O	F	CN	(3-) F	
IX-12	O	F	CN	(2-) F	
IX-13	O	F	CN	(4-) Br	
IX-14	O	H	CN	(4-) OH	
IX-15	O	H	CN	(4-) OCH ₃	
IX-16	O	H	CN	(4-) Cl	
IX-17	O	H	CN	(4-) F	
IX-18	O	F	CF ₃	-	
IX-19	O	F	CF ₃	(4-) CH ₃	
IX-20	O	F	CF ₃	(4-) OCH ₃	
IX-21	S	H	CN	-	

Bsp.- Nr.	Q	R ⁴	R ³	X _n	Physikal. Daten
IX-22	S	F	CN	-	
IX-23	S	F	CN	(4-) Cl	
IX-24	S	F	CN	(4-) F	
IX-25	O	F	CF ₃	(4-) CN	

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 4 und 6 starke Wirkung gegen Unkräuter.

30

Beispiel B

Post-emergence-Test

5 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die ange-
gebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die ge-
wünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 -
15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit
ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in
1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung
im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

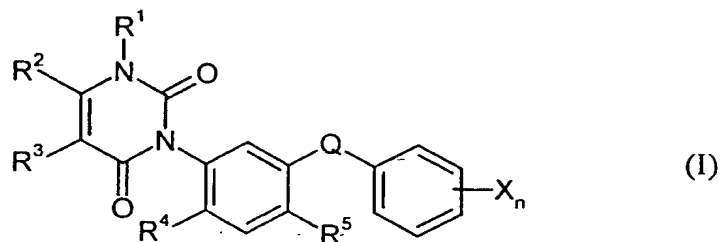
100 % = totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 4
und 6 starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)



5 in welcher

n für die Zahlen 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 steht,

10 Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(Alkyl) steht,

R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl steht,

15

R³ für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,

20

R⁵ für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxy steht, und

25

X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substi-

5 tuitiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkyl-
amino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylamino-
carbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl-
oxy, Alkylaminocarbonyloxy, Dialkylaminocarbonyloxy, Phenyl-
carbonyloxy, Alkylcarbonylamino, Alkoxycarbonylamino, Alkyl-
sulfonylamino, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl,
Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl steht - wobei für den Fall, daß n
größer als 1 ist, X in den einzelnen möglichen Verbindungen auch ver-
schiedene der angegebenen Bedeutungen haben kann.

- 10 2. Substituierte Phenyluracile gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- n für die Zahlen 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,
- 15 Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(C₁-C₄-Alkyl)
steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy,
20 Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substitu-
iertes C₁-C₄-Alkyl steht,
- R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gege-
benenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy sub-
stituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl steht,
- 25 R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor
oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl steht,
- R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder
30 Brom steht,

R⁵ für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy steht, und

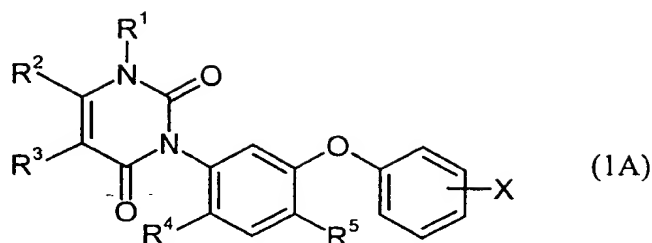
5 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyl-oxycarbonyl, C₂-C₄-Alkynyl-oxycarbonyl, C₁-C₄-Alkyl-amino-carbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-carbonyl, Phenoxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituier-
 10 tes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder Alkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für Dialkyl-amino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylamino-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyloxy oder Alkylamino-carbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-
 15 gruppen, für Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminocarbonyloxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für Phenylcarbonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkylcarbonylamino, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano,
 20 Carboxy, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkynyloxy oder Alkynyloxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht.

30 3. Substituierte Phenyluracile gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

- n für die Zahlen 1, 2 oder 3 steht,
- Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO, SO₂, NH oder N(CH₃) steht,
- 5 R¹ für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,
- 10 R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,
- 15 R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
- R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
- 20 R⁵ für Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl steht, und
- 25 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Dimethylamino-
- 30

carbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxycarbonyl, Benzyloxy-
 carbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl sub-
 stituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl,
 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methyl-
 5 thio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl,
 Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-
 Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, für Dimethylamino oder Di-
 ethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor,
 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Acetyl, Propionyl,
 10 n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-
 Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder
 i-Propylaminocarbonyl, Acetyloxy, Propionyloxy, n- oder i-Bu-
 tyroyloxy, Methoxycarbonyloxy, Ethoxycarbonyloxy, n- oder i-Prop-
 oxycarbonyloxy, Methylaminocarbonyloxy, Ethylaminocarbonyloxy,
 15 n- oder i-Propylaminocarbonyloxy, für Dimethylaminocarbonyl, Di-
 ethylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyloxy oder Diethylamino-
 carbonyloxy, für Phenylcarbonyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch
 Fluor oder Chlor substituiertes Acetylamino, Propionylamino, n- oder
 i-Butyrylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n-
 20 oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonyl-
 amino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonyl-
 amino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor,
 Chlor, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl,
 Propenyl, Propenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl,
 25 Propinyloxy oder Propinyloxycarbonyl steht.

4. Substituierte Phenyluracile gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die allgemeine Formel (IA),



in welcher

R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

R² für Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Difluormethyl oder Pentafluorethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano oder Thiocarbamoyl steht, und

X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxycarbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylamino-carbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio,

Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.

5. Substituierte Phenyluracile gemäß Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß

5

R^1 für Methyl steht,

R^2 für Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Difluormethyl oder Pentafluorethyl steht,

10

R^3 für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R^4 für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

15

R^5 für Fluor, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht, und

X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, Allyloxycarbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylamino-carbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.

20

25

30

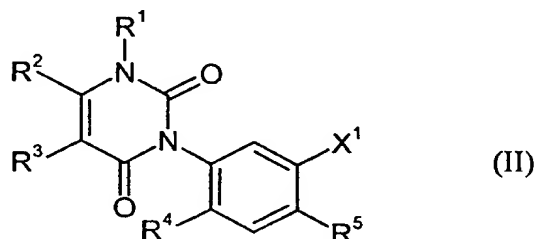
6. Substituierte Phenyluracile gemäß Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, daß

- R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,
- 5 R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thicarbamoyl, Methoxycarbonyl
oder Ethoxycarbonyl steht,
- R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,
- 10 R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
- R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder Trifluormethyl
steht, und
- 15 X für Hydroxy, Mercapto, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl,
Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls
durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n-
oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-
Propoxy-carbonyl, Allyloxycarbonyl, Propargyloxycarbonyl, 1-Buten-
20 3-yl-oxy-carbonyl, 2-Buten-4-yl-oxy-carbonyl, Propargyloxycarbonyl,
1-Butin-3-yl-oxy-carbonyl, 2-Butin-4-yl-oxy-carbonyl, Methylamino-
carbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl, Di-
methylaminocarbonyl, Diethylamino-carbonyl, Phenoxycarbonyl,
Benzyloxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl oder Benzylaminocarbonyl
25 substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio,
Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl, oder für durch Methoxy-
carbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Ethenyl steht.

7. Substituierte Phenyluracile gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch
gekennzeichnet, daß n für 1 steht.

8. Substituierte Phenyluracile gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, daß R² für Trifluormethyl steht.
9. Substituierte Phenyluracile gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß R⁴ für Fluor steht.
10. Substituierte Phenyluracile gemäß einem der Ansprüche 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, daß R⁵ für Cyano oder Thiocarbamoyl steht.
11. Verfahren zum Herstellen von substituierten Phenyluracilen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10, dadurch gekennzeichnet, daß man

(a) Halogenophenyluracile der allgemeinen Formel (II)

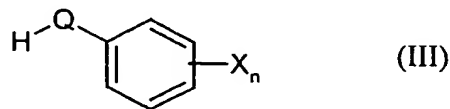


in welcher

R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben und

X¹ für Halogen steht,

mit Arylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

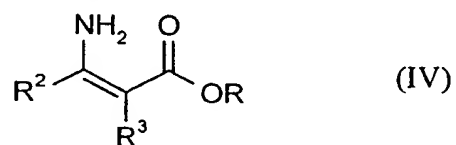
n, Q und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben,

- oder mit Metallsalzen von Verbindungen der allgemeinen Formel (III) -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder daß man

(b) Aminoalkensäureester der allgemeinen Formel (IV)

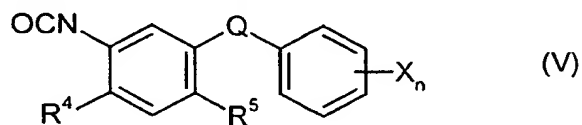


in welcher

R^2 und R^3 die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

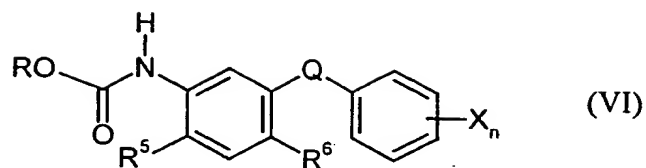
mit Arylisocyanaten der allgemeinen Formel (V)



in welcher

n, Q, R^4 , R^5 und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben,

oder mit Arylurethanen (Arylcarbamaten) der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

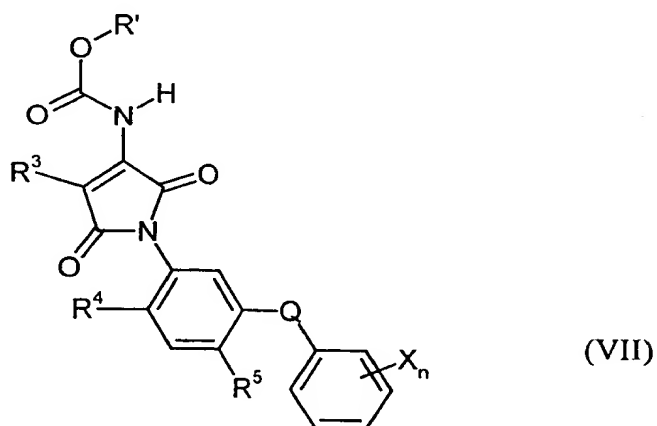
n, Q, R⁵, R⁶ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder daß man

(c) N-Aryl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen Formel (VII)



in welcher

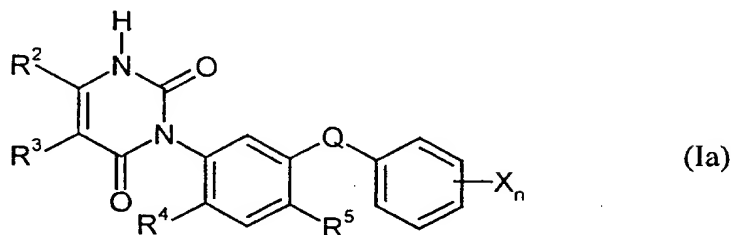
n, Q, R³, R⁴, R⁵ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben und

R⁶ für Alkyl steht,

mit einem Metallhydroxid in Gegenwart von Wasser und gegebenenfalls in
Gegenwart eines organischen Lösungsmittels umsetzt,

oder daß man

(d) substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (Ia)



in welcher

n, Q, R², R³, R⁴, R⁵ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene
Bedeutung haben,

mit 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol oder mit Alkylierungsmitteln der allge-
meinen Formel (VIII)



in welcher

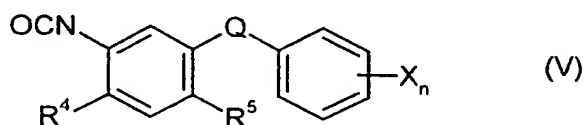
A¹ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und

X² für Halogen oder die Gruppierung -O-SO₂-O-A¹ steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

und gegebenenfalls im Anschluß daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

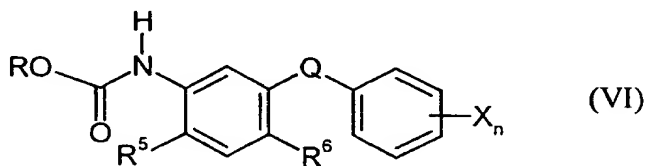
12. Arylisocyanate der allgemeinen Formel (V)



in welcher

n, Q, R⁴, R⁵ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 7, 9 und 10 angegebene Bedeutung haben.

13. Arylurethane (Arylcarbamate) der allgemeinen Formel (VI)

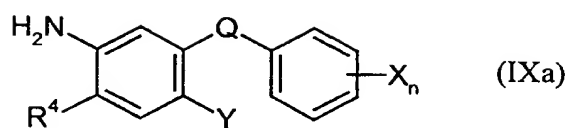


in welcher

n, Q, R⁵, R⁶ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 7 und 10 angegebene Bedeutung haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht.

14. Anilinderivate der allgemeinen Formel (IXa)

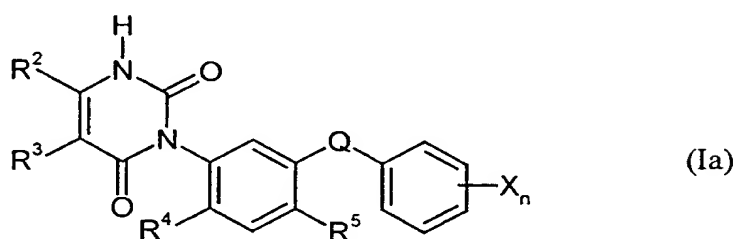


in welcher

n, R⁴ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 7 und 9 angegebene Bedeutung haben und

Y für Cyano, Thiocarbamoyl oder Trifluormethyl steht.

15. Substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (Ia)



in welcher

n, Q, R², R³, R⁴, R⁵ und X die in einem der Ansprüche 1 bis 10 angegebene Bedeutung haben.

16. Verwendung von mindestens einem substituierten Phenyluracil gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.

17. Herbizides Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt an mindestens einem substituierten Phenyluracil gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10.



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/04585

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/54 A01N43/54 C07C255/59 C07C327/48 C07C217/90
C07C265/12 C07C271/28

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DE 195 27 570 A (BAYER) 30 January 1997 (1997-01-30) page 1 -page 5; claims ---	1,11,16, 17
X	WO 93 14073 A (DU PONT DE NEMOURS) 22 July 1993 (1993-07-22) cited in the application page 1 -page 24; claims; examples 1-4; table 1 ---	1,11,16, 17
P,X	WO 98 41093 A (ISHIHARA) 24 September 1998 (1998-09-24) cited in the application page 1 -page 48; claims; figure 09; examples 17,18; table 9 -----	1,11,12, 14-17

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

30 September 1999

Date of mailing of the international search report

11/10/1999

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/04585

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 19527570 A	30-01-1997	AU 6656696 A CA 2227762 A CN 1196725 A WO 9705116 A EP 0842155 A	26-02-1997 13-02-1997 21-10-1998 13-02-1997 20-05-1998
WO 9314073 A	22-07-1993	AU 3427193 A BR 9207072 A CA 2128232 A CN 1074441 A EP 0623117 A IL 104388 A US 5602077 A US 5567670 A ZA 9300272 A	03-08-1993 05-12-1995 22-07-1993 21-07-1993 09-11-1994 09-05-1999 11-02-1997 22-10-1996 15-07-1994
WO 9841093 A	24-09-1998	AU 5816198 A HR 980135 A ZA 9802158 A	12-10-1998 28-02-1999 14-09-1998

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Int lationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/04585

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/54 A01N43/54 C07C255/59 C07C327/48 C07C217/90
C07C265/12 C07C271/28

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N C07C

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DE 195 27 570 A (BAYER) 30. Januar 1997 (1997-01-30) Seite 1 -Seite 5; Ansprüche	1,11,16, 17
X	WO 93 14073 A (DU PONT DE NEMOURS) 22. Juli 1993 (1993-07-22) in der Anmeldung erwähnt Seite 1 -Seite 24; Ansprüche; Beispiele 1-4; Tabelle 1	1,11,16, 17
P,X	WO 98 41093 A (ISHIHARA) 24. September 1998 (1998-09-24) in der Anmeldung erwähnt Seite 1 -Seite 48; Ansprüche; Abbildung 09; Beispiele 17,18; Tabelle 9	1,11,12, 14-17

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

30. September 1999

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

11/10/1999

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

INTERNATIONALER CHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/04585

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE 19527570 A	30-01-1997	AU 6656696 A	26-02-1997
		CA 2227762 A	13-02-1997
		CN 1196725 A	21-10-1998
		WO 9705116 A	13-02-1997
		EP 0842155 A	20-05-1998
WO 9314073 A	22-07-1993	AU 3427193 A	03-08-1993
		BR 9207072 A	05-12-1995
		CA 2128232 A	22-07-1993
		CN 1074441 A	21-07-1993
		EP 0623117 A	09-11-1994
		IL 104388 A	09-05-1999
		US 5602077 A	11-02-1997
		US 5567670 A	22-10-1996
		ZA 9300272 A	15-07-1994
WO 9841093 A	24-09-1998	AU 5816198 A	12-10-1998
		HR 980135 A	28-02-1999
		ZA 9802158 A	14-09-1998